

⑨ 日本国特許庁 (JP)  
⑫ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開  
昭55-124763

⑤ Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 D 213/64  
213/70

識別記号 庁内整理番号  
7138-4C  
7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1  
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

① 特 願 昭54-32068  
② 出 願 昭54(1979)3月19日  
③ 発 明 者 西山隆三  
高槻市真上町5丁目41番22号  
④ 発 明 者 藤川致一  
守山市浮気町321番地の31  
⑤ 発 明 者 横道勲  
草津市野村町221番地

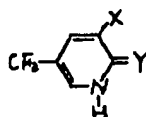
⑥ 発 明 者 芳賀隆弘  
草津市野村町221番地  
⑦ 発 明 者 長谷邦昭  
守山市浮気町321番地の31  
⑧ 発 明 者 林弘仁  
守山市浮気町321番地の31  
⑨ 出 願 人 石原産業株式会社  
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-  
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

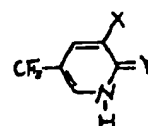


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

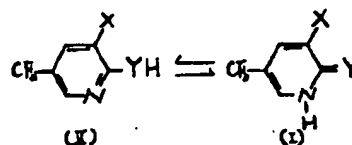
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

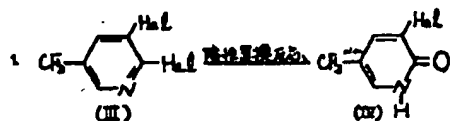
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



(式中X及びYは前記の通りである)

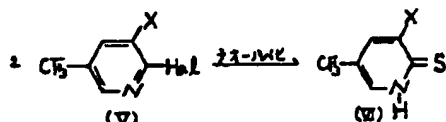
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、碘素が挙げられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ピリ  
 ドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製  
 造される。



(上記反応式中 H<sub>a</sub>L はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ  
 メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶  
 媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど  
 のアルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1  
 ～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び H<sub>a</sub>L は前述の通りで  
 ある)

一般に上記反応はメタノール、エタノールな  
 どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ  
 メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

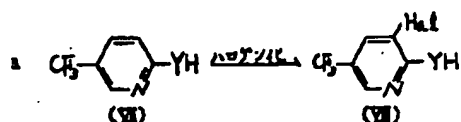
- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾイ  
 ル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルピリ  
 ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化  
 合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3  
 -クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリ  
 ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを  
 縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
 ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-  
 イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2,6-  
 ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを  
 反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ  
 イル)-N'-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
 ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-  
 イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで  
 きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた  
 活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の  
 防除に有効であって、例えばこの化合物<sup>2</sup>100  
 ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それ  
 を風乾してそこへ2～3令のコナガの幼虫を放  
 ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 5 -

H隆昭55-124763(2)

幼虫などの溶液中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ  
 硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ  
 ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50～  
 還流温度0.5～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び H<sub>a</sub>L は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、  
 酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒  
 などの溶液中、窒素ガス、臭素、チオニルクロ  
 ライド、スルフィルクロライドなどのハロゲン  
 化剤を用いて0～100℃、0.5～10時間で行  
 なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ  
 ンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロ  
 メチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベン  
 ゼン類を生成させ、これを還元して得られる4-  
 (5-トリフルオロメチルピリジン-2-イ  
 ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアネ

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ  
 ル-2-ピリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0  
 2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50  
 ℃に加温して塩素ガスを1時間攪拌下に通じ  
 た。反応終了後、クロロホルムを留去し、ト  
 ルエン-n-ヘキサンの混合溶媒で再結晶し  
 て融点144～147℃の目的物0.15gを  
 得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水125mlに溶  
 解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリ  
 フルオロメチルピリジン4gを加え、更にジ  
 メチルスルホキシド125mlを加えて加熱し、  
 110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応  
 終了後生成物を冷却し、濃塩酸で酸性にして  
 沈殿物を得、このものを濾過して目的物2.5

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ  
ピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピ  
リジン4ヲとチオ尿素167ヲとをエタノール  
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時  
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ  
ウム水溶液123ヲを徐々に加えて還流状態  
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を  
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化  
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い  
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後  
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ  
ンを留去して融点147~150℃の目的物  
2.1ヲを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-ピリドン

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0  
4ヲを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0  
4ヲを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特願55-124763(3)

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-ロ  
-ヘキサンの混合溶液で再結晶して融点162  
~165℃の目的物0.45ヲを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-チオピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピ  
リジン4ヲに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ  
フルオロメチルピリジン4.75ヲを用いる以  
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、  
後処理を行なって融点126~128℃の目  
的物1.9ヲを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -